

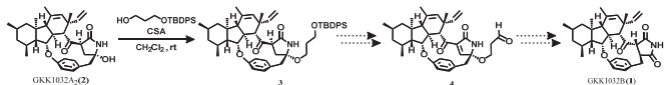
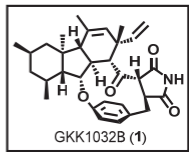
22L-am04S

抗腫瘍活性物質 GKK1032B の全合成研究

○中谷 祐介¹, 坪郷 哲^{1,2}, 内呂 拓実^{1,2} (¹東京理大薬, ²東京理大戦略的物理製剤学研セ)

【目的】GKK1032B (**1**)¹⁾は、2001年に協和発酵工業の研究グループによって *Penicillium* sp. GKK1032 株から見出された抗腫瘍活性物質である。本化合物は、9つの不斉中心を有するデカヒドロフルオレン骨格に加えて、スクシンイミドを内包する高度に歪んだ 12員環構造を有している。当研究室では、これまでに類縁化合物である GKK1032A₂ (**2**)の全合成を達成している²⁾。そこで演者らは、**2**のラクタム環のγ位水酸基に保護基を導入した後、α-β位間の不飽和化を経て生合成経路として提唱されている転位反応を行うことにより、スクシンイミド構造を構築する合成戦略に基づき、**1**の初の全合成を達成すべく研究を行った。

【方法・結果】まず、当研究室において確立した方法により GKK1032A₂ (**2**)を合成した後、プロパンジオール由来の保護基を導入した保護体 **3**を合成した。今後は、不飽和ラクタムへの誘導、TBDPS 基の除去と生じた水酸基の酸化反応を経て、不飽和ラクタム **4**に導いた後、β脱離反応による脱保護と続く転位反応を経て、**1**の全合成を達成したいと考えている。



1) Koizumi, F. *et al.*, Jpn. Kokai Tokkyo Koho JP 2001247574 A 20010911, **2001**.

2) Sugata, H.; Uchiro, H. *et al.*, *Chem. Asian J.* **2017**, *12*, 628.